

Composition for the treatment of opacity in the region of the eye

Patent Number: DE3133003

Publication date: 1983-03-10

Inventor(s): GAURI KAILASH KUMAR PROF DR (DE)

Applicant(s): GAURI KAILASH KUMAR

Requested Patent: DE3133003

Application Number: DE19813133003 19810820

Priority Number(s): DE19813133003 19810820

IPC Classification: A61K35/14; A61K33/18; A61K33/04; A61K31/375

EC Classification: A61K35/14

Equivalents:

Abstract

A composition for the treatment of opacity in the region of the eye contains apart from alkali metal iodide and, where appropriate, alkali metal thiosulphate an addition of dialysis concentrate from deproteinised blood from young animals.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

THIS PAGE BLANK (USPTO)

(19) BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

(12) **Offenlegungsschrift**
(11) **DE 31 33 003 A1**

Cl. 3:
A 61 K 35/14
A 61 K 33/18
A 61 K 33/04
A 61 K 31/375

(21) Aktenzeichen: P 31 33 003.7
(27) Anmeldetag: 20. 8. 81
(43) Offenlegungstag: 10. 3. 83

(71) Anmelder:
Gauri, Kailash Kumar, Prof. Dr., 2359 Lentföhrden, DE

(72) Erfinder:
gleich Anmelder

DE 31 33 003 A1

Beförderneigatum

(54) **Mittel zur Behandlung von Trübungen im Bereich des Auges**

Mittel zur Behandlung von Trübungen im Bereich des Auges, das neben Alkalijod und ggf. Alkalithiosulfat einen Dialysekonzentratzusatz aus deproteinisiertem Blut junger Tiere enthält. (31 33 003)

DE 31 33 003 A1

20.08.81

- X -
3133003

P a t e n t a n s p r ü c h e

1. Mittel zur Behandlung von Trübungen im Bereich des Auges, das in wässriger Lösung ein Alkalijodid und gegebenenfalls ein Alkalithiosulfat enthält, dadurch gekennzeichnet, daß es außerdem ein Dialysekonzentrat aus deproteinisiertem Blut junger Tiere, welches sämtliche Blutbestandteile mit einem Molekulargewicht unterhalb von 10 000 enthält, und gegebenenfalls Ascorbinsäure enthält.
2. Mittel nach Anspruch 1, enthaltend 0,014 bis 1 % Alkalijodid, 0,5 bis 3 Gew.-% Alkalithiosulfat, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Dialysekonzentrat aus deproteinisiertem Blut junger Tiere bis zu 15 % des Mittels beträgt.
3. Mittel nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß es außerdem 0,5 bis 5 Gew.-% Ascorbinsäure und/oder 0,05 bis 0,3 Gew.-% Natriumglycerophosphat enthält.

20.08.81

3133003

PATENTANWÄLTE
REITSTÖTTER,
KINZEBACH & PARTNER
7-8 MÜNCHEN 43, BAUERSTR. 27
FONTEAG 1 760

München, 20. August 1981

M/22 194

Prof.Dr.Kailash Kumar GAURI
2359 Lentföhrden

Mittel zur Behandlung von Trübungen
im Bereich des Auges

20.08.81
3

3133003

- 2 -

Die Erfindung betrifft ein Mittel zur Behandlung von Trübungen im Bereich des Auges, das ein Alkalijodid und ein Dialysekonzentrat aus deproteinisiertem Blut junger Tiere und gegebenenfalls Thiosulfat bzw. Ascorbinsäure enthält.

Man nimmt aufgrund neuerer Untersuchungen an, daß Trübungen im Bereich der Augenlinse im wesentlichen darauf zurückzuführen sind, daß die freien SH-Funktionen der Linsen-Proteine über S-S-Brücken vernetzen, wodurch ein Teil der Transparenz des Linsenkörpers verlorengeht (vgl. J.J.Harding und K.J.Dilley, Exp. Eye Res. 22, 1-73 (1976)).

Neuere Untersuchungen von Gauri (K.K.Gauri, Der Augenspiegel, Heft 2, 1979, Seiten 2 bis 7) deuten darauf hin, daß die Anwesenheit von Jod im Auge die Linsen-Proteine günstig beeinflußt, so daß die Bildung von Quervernetzungen erschwert oder gar verhindert wird. Aufgrund der Fähigkeit von Jod, seinen Wertigkeitszustand rasch und leicht zu wechseln, kann man davon ausgehen, daß Jod nicht nur die Entstehung von Disulfidbrücken verhindert, sondern auch bereits gebildete Disulfidbrücken wieder spalten kann. Folglich dürfte Jod die Katarakt-Entstehung prophylaktisch verhindern und zu einem gewissen Grad auch die bereits entstandenen Trübungen zurückbilden können.

Voraussetzung für eine derartige Wirkung von jodidhaltigen Lösungen, ist eine ausreichende Bioverfügbarkeit von Jodionen bzw. Jod im Bereich der Augenlinse. Untersuchungen mit radioaktiv markiertem Jod am Kaninchenauge haben gezeigt, daß bei der Verwendung von wäßrigen Alkalijodid-haltigen Lösungen die in der Linse anzutreffende Jodkonzentration zu gering ist, um eine therapeutische Wirkung verursachen zu können. Daraus erklärt sich auch die umstrittene Wirkung der bekannten jodhaltigen Mittel zur Behandlung von Trübungen im Bereich des Auges.

Zur Erhöhung der Bioverfügbarkeit von Jod im Bereich des Auges wird in der deutschen Offenlegungsschrift 2 925 804 ein Mittel zur Behandlung von Trübungserscheinungen im Bereich der Augenlinse und des Glaskörpers des Auges vorgeschlagen, das ein Alkalijodid und ein Thiosulfatsalz enthält. Dieses Mittel ist in der Lage, *in vitro* die Linsenproteine zu stabilisieren. Den im Laufe der Zeit fortschreitenden Trübungserscheinungen kann jedoch damit nicht erfolgreich begegnet werden.

Der vorliegenden Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde, ein Arzneimittel für die Human- und Veterinärmedizin bereitzustellen, das nicht nur stabilisierend auf die Linsenproteine wirkt, sondern auch den fortschreitenden Trübungserscheinungen entgegenwirkt.

Überraschenderweise wurde nun gefunden, daß durch den Zusatz eines bestimmten Dialysekonzentrates aus deproteinisiertem Kälberblut, welches sämtliche Blutbestandteile mit einem Molekulargewicht unterhalb von 10 000 enthält, zu einem Alkalijodid-haltigen Augenmittel, Trübungen im Bereich der Augenlinse und des Glaskörpers des Auges wesentlich wirksamer entgegengewirkt werden kann.

Gegenstand der Erfindung ist daher ein Alkalijodid-haltiges wäßriges Mittel zur Behandlung von Trübungen im Bereich des Auges, das gegebenenfalls auch ein Alkalithiosulfat enthält, und das durch einen Zusatz an einem Dialysekonzentrat aus deproteinisiertem Blut junger Tiere, welches sämtliche Blutbestandteile mit einem Molekulargewicht unterhalb von 10 000 enthält, gekennzeichnet ist. Der Gehalt an Alkalijodid liegt vorzugsweise im Bereich von 0,014 bis 1 Gew.-%, das gegebenenfalls vorhandene Thiosulfat macht etwa 0,5 bis 3 Gew.-% aus und das Dialysekonzentrat aus deproteinisiertem Blut macht bis zu 15 % des Mittels aus. Gewünschtenfalls kann außerdem noch ein Zusatz von Ascorbinsäure in der Größenordnung von 0,5 bis 5 Gew.-%, vorzugsweise 3 Gew.-%, und/oder von Natriumglycerophosphat, 0,05 bis 0,3 Gew.-%, vorzugsweise 0,1 Gew.-%, verwendet werden.

5
20.08.81

3133003

- A -

Das Dialysekonzentrat aus deproteinisiertem Blut ist als standardisierte wässrige Lösung oder als standard Feststoff unter den Handelsbezeichnungen Solcosery oder Actovegin® erhältlich.

Als Alkalijodid verwendet man vorzugsweise Natriumjodid und als Alkalithiosulfat verwendet man vor: thiosulfat.

Das erfindungsgemäße Mittel kann als topisch e Lösung, als Gel, Salbe oder als orales Präparat:

B e i s p i e l 1

Topisches Präparat:

Kaliumjodid
Natriumthiosulfat
Solcoseryl® (flüssig; Standardprodukt, 20 %)
Hilfsmittel ad

B e i s p i e l 2

Orales Präparat:

| | | |
|------------------------------------|-----|---|
| Natriumjodid | 1 | g |
| Natriumthiosulfat | 0,5 | g |
| Ascorbinsäure | 5 | g |
| Solcoseryl® (Standardprodukt 20 %) | 80 | g |
| Natriumglycerophosphat | 0,1 | g |
| Hilfsmittel ad | 100 | g |